

abemaciclib mesylate(LY2835219): LY2835219 mesylate

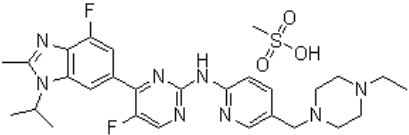
产品编号: MB5135

质量标准: >98%, CDK4 和 CDK6 选择性抑制剂;甲磺酸盐

包装规格: 10MG;50MG;200MG

产品形式: solid

基本信息

分子式	C27H32F2N8.CH4O3S	结 构 式	
分子量	602.7		
CAS No.	1231930-82-7		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO: 83 mg/mL (137.71 mM)		
	Water : 100 mg/mL (165.92 mM)		
	Ethanol : 24 mg/mL (39.82 mM)		
注意事项	溶解性是在室温下测定的, 如果温度过低, 可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。		

简介: LY2835219 是选择性的 **CDK4/6** 抑制剂, 抑制 CDK4/CDK6 的 IC_{50} 分别为 2 nM 和 10 nM。

别名: abemaciclib (LY2835219): CDK4/6 dual inhibitor; 2-Pyrimidinamine, N-[5-[(4-ethyl-1-piperazinyl)methyl]-2-pyridinyl]-5-fluoro-4-[4-fluoro-2-methyl-1-(1-methylethyl)-1H-benzimidazol-6-yl]-, methanesulfonate (1:1)

物理性状及指标:

外观:淡黄色粉末

溶解性:DMSO: 83 mg/mL (137.71 mM); Water : 100 mg/mL (165.92 mM); Ethanol : 24 mg/mL (39.82 mM)

含量:>98%

储存条件: -20℃, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	LY2835219 是有效的, CDK4 和 CDK6 选择性抑制剂, IC_{50} 分别为 2 nM 和 10 nM。	
靶点	CDK4(Cell-free assay)	CDK6(Cell-free assay)
IC50	2 nM	10 nM
体外研究	LY2835219 是一种口服有效的细胞周期蛋白依赖性激酶 (CDK) 抑制剂, 靶向作用于 CDK4 (cyclin D1) 和 CDK6 (cyclin D3) 细胞周期通路, 具有潜在的抗肿瘤活性。	

	LY2835219 特异性抑制 CDK4 和 6, 从而在早 G1 期抑制视网膜母细胞瘤 (Rb) 蛋白磷酸化。抑制 Rb 磷酸化, 防止 CDK-介导的 G1-S 期转换, 从而使细胞周期停滞在 G1 期, 抑制 DNA 合成, 且抑制癌细胞生长。某些类型的癌症中丝/苏氨酸激酶 CDK4/6 的过表达, 导致细胞周期调节失控。
体内研究	LY2835219-MsOH 处理脑的剂量百分比为 0.5–3.9%。LY2835219-MsOH 处理皮下和颅内胶质瘤模型 (U87MG), 抑制肿瘤生长, 这种作用存在剂量依赖性, 不管是单独处理, 还是与 Temozolomide 联用。

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB5136	LEE011
MB4355	Palbociclib (PD-0332991)
MB2801	Palbociclib (PD-0332991) HCl
MB4024	Palbociclib (PD0332991) Isethionate

用途及描述: 科研试剂, 广泛应用于分子生物学, 药理学等科研方面, 严禁用于人体。LY2835219 是选择性的 CDK4/6 抑制剂, 本品适用于肿瘤治疗等相关领域的科研实验。

储液配置:

体 水 质 量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.6592 mL	8.2960 mL	16.5920 mL
5 mM	0.3318 mL	1.6592 mL	3.3184 mL
10 mM	0.1659 mL	0.8296 mL	1.6592 mL
50 mM	0.0332 mL	0.1659 mL	0.3318 mL

经典实验操作 (来源于公开文献, 仅供参考)

激酶实验	将细胞 (5×10 ³) 铺板于 96 孔板中。第二天处理细胞 24 至 48 小时, 然后根据制造商的说明书和发光板读数器通过 Caspase-Glo-3/7 测定法评估胱天蛋白酶-3 活性。
细胞实验	将细胞接种在 96 孔板中, 使其粘附过夜, 并用 DMSO 对照 (0.1%v/v) 或所示化合物处理 72 小时。根据制造商的说明使用细胞计数试剂盒测定细胞活力和增殖。使用 CompuSyn 测定 LY2835219 和 mTOR 抑制剂之间的相互作用。组合指数 (CI) 值 1 表示添加剂药物相互作用, 而 CI <1 是协同的, CI > 1 是拮抗性的。
动物实验	给 6 周龄 BALB / c 雌性裸鼠皮下注射 OSC-19 (1×10 ⁶) 细胞。当肿瘤大小达到约 100mm ³ 时, 通过肿瘤大小随机化小鼠并进行每次治疗。每个治疗组包括至少 5 只小鼠。每组小鼠通过每日口服管饲给予载体 LY2835219 (45mg / kg /天或 90mg / kg /天), 依维莫司 (5mg / kg /天) 或两者的组合。将 LY2835219 溶于 1%HEC 的 20mM 磷酸盐缓冲液 (pH2.0) 中。每周两次测量肿瘤大小和体重。使用以下公式计算肿瘤体积: V = (L×W ²) / 2 (L, 长度; W, 宽度)。在第 14 天最后一次对小鼠进行强饲, 并在第二天处死。取出肿瘤进行 Western 印迹和免疫组织化学。

【注意】

- 我司产品为非无菌包装, 若用于细胞培养, 请提前做预处理, 除去热原细菌, 否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息, 我司不保证所提供信息的权威性, 以上数据仅供参考交流研究之用。

活性化合物操作注意事项

1 产品分装: 您收到货物后最好不要自己进行分包, 因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质; 如您有特殊包装要求, 请在订购时候与我们客服代表阐明, 当然价格会做适当调整。对于开盖后, 长期未使用的, 请务必重新密封好, 建议 Parafilm 封口膜, 并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长, 超过产品有效期, 建议您重新购买, 以免影响实验质量。

2 储备液制备: 大部分试剂的溶液形式稳定性较差, 请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液, 请选用合适溶剂, 细胞培养类多选择 DMSO, 储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存, 一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前, 再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备: 请根据个人需要正确计算浓度, 稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的, 所以使用水性溶剂(如 PBS)稀释时, 可能会析出沉淀, 可通过超声使固体重新溶解, 不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂, 请确保 DMSO 最终使用浓度 < 0.3%, 以避免细胞毒性。

灭菌方式, 我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌, 请勿采用紫外, 射线或者高温灭菌方式, 否则会影响化合物活性, 甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用: 由于很多化合物是脂溶性的, 动物实验工作液配制失活, 可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂, 如吐温, CMC-NA, 甘油等, 具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO, 请确保 DMSO 的终浓度 < 5%, 以避免毒性作用。给药剂量设计时候, 可以参考下表动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M ²)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg) = 动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数 / 动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后, 请及时查验产品的包装完整性, 并对数量进行确认。对于很多微量的产品, 数量低于 500MG 的, 我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置, 从而导致产品附着在管壁或者盖子上, 这时候请不要先打开盖子, 需正位放置轻轻拍打, 使产品沉降到管底。对于液体产品, 可以在 200 转左右稍作离心, 管底收集液体, 从而避免损失。产品标签标示重量会有一定误差, 在下面范围内均属于我司正常范围, 望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。